PCT WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM
Internationale Anmeldung veröffentlicht nach dem Vertrag über die
Internationale zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 239/54, A01N 43/54, C07D 403/10, 409/12, 401/12, 401/10

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/09319

A1 (43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

13. März 1997 (13.03.97)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP96/03693

- (22) Internationales Anmeldedatum: 22. August 1996 (22.08.96)
- (30) Prioritätsdaten:

ĸ.

195 32 344.0

4. September 1995 (04.09.95) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BAYER AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): ANDREE, Roland [DE/DE]; Dechant-Miebach-Weg 37, D-40764 Langenfeld (DE). DREWES, Mark, Wilhelm [ZA/DE]; Goethestrasse 38, D-40764 Langenfeld (DE). DOLLINGER, Markus [DE/DE]; Burscheider Strasse 154b, D-51381 Leverkusen (DE).
- AKTIENGE-BAYER (74) Gemeinsamer Vertreter: SELLSCHAFT; D-51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AU, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, HU, JP, KR, KZ, LK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SK, TR, UA, US, europäisches Patont (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit Internationalem Recherchenbericht.

- (54) Title: SUBSTITUTED 1-AMINO-3-PHENYLURACIL DERIVATIVES, THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBI-
- (54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE 1-AMINO-3-PHENYL-URACIL-DERIVATE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VER-WENDUNG ALS HERBIZIDE

(57) Abstract

The invention concerns substituted amino uracils of the general formula (I) in which R¹ is hydrogen, cyano or halogen, R² is cyano or thiocarbamoyl, R³ is hydrogen or an optionally substituted group selected from the series alkyl, alkylcarbonyl, alkenyl, alkenylcarbonyl, alkinyl, alkinylcarbonyl, cycloalkyl, cycloalkylcarbonyl, cycloalkylalkyl, cycloalkylalkylcarbonyl, arylcarbonyl, arylalkylcarbonyl or heterocyclylcarbonyl, R⁴ is hydrogen or an optionally substituted group selected from the series alkyl, alkylcarbonyl, alkenyl, alkenylcarbonyl, alkinyl, alkinylcarbonyl, cycloalkyl, cycloalkylcarbonyl, cycloalkylaikyl, cycloalkylaikylcarbonyl, arylcarbonyl, arylalkylcarbonyl or heterocyclylcarbonyl or, together with R3, forms an optionally substituted alkanediyl, oxoalkanediyl or dioxoalkanediyl group, R5 is hydrogen or optionally substituted alkyl or alkoxy, R6 is optionally substituted alkyl, R7 is hydrogen or an optionally sub**(I)**

stituted group selected from the series alkyl, alkenyl or alkinyl and R8 is hydrogen or an optionally substituted group selected from the series alkyl, alkenyl or alkinyl. The invention also concerns methods of preparing such compounds and their use as herbicides.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft neue substitulerte Aminouracile der allgemeinen Formel (I), in welcher R¹ für Wasserstoff, Cyano oder Halogen steht, R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht, R³ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls aubstitulierten Rest der Reihe Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylcarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylcarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Aryl

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AT	Osterreich	CE	Georgien	NE	Niger
ΑU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BD	Barbados	GR	Gricchenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ.	Neuseoland
BF	Burkina Faso	31	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarico	IT	Italian	PT	
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Portugal
BR	Brasillen	KE	Kenya	RU	Ruminien
BY	Bolarus	KG	Kirgistan	SD	Russische Föderation
CA	Kanada	KP	_		Sudan
CF	Zentralo Afrikanische Republik	KR.	Demokratische Volksrepublik Korea Republik Korea	SE	Schweden
CG	Kongo	KZ	•	SG	Spilaton
CH	Schwelz	LI	Kasachatan	SI	Slowenien
Ct	Côte d'Ivoire		Liechtenstein	SK	Slowakci
CM	Kamerun	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CN	China	LR	Liberia	SZ	Swasiland
C9		LX	Litauen .	TD	Techad
CZ	Tschechoslowake]	LU	Luxemburg	TG	Togo
DE DE	Tschechlsche Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
	Deutschland	MC	Monsco	TT	Trinkdad und Tobago
DK	Dânemark	MD	Republik Moldan	UA	Ukraine
EE	Estland	МG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanlen	ML	Mail	us	Vereinigte Staaten von Amerik
P)	Pinnland	MN	Mangolel	U2	Usbeklitan
PR	Prankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Molawi	***	A ICCUIDE

SUBSTITUIERTE 1-AMINO-3-PHENYL-URACIL DERIVATE, DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS HERBIZIDE

Die Erfindung betrifft neue substituierte Aminouracile, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Herbizide.

Es ist bekannt, daß bestimmte substituierte Uracile herbizide Eigenschaften aufweisen (vgl. EP 408382 / US 5084084 / US 5127935 / US5154755 / EP 563384 / EP 648749 / WO 91/00278 / US 4979982 / US 5169430). Diese Verbindungen haben jedoch bisher keine nennenswerte Bedeutung erlangt.

10 Es wurden nun die neuen substituierten Aminouracile der allgemeinen Formel (I)
gefunden

in welcher

20

R1 für Wasserstoff, Cyano oder Halogen steht,

15 R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht,

R³ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl oder Heterocyclylcarbonyl steht,

- für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl oder Heterocyclylcarbonyl steht, oder zusammen mit R³ für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkandiyl, Oxoalkandiyl oder Dioxoalkandiyl steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkyl oder Alkoxy steht,
- R⁶ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,
- 10 R⁷ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl steht, und
 - R⁸ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl steht.

Man erhält die neuen substituierten Aminouracile der allgemeinen Formel (I), wenn man

Aminouracile der allgemeinen Formel (II)

in welcher

R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

20 Z für gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonylamino oder die Gruppierung NR³R⁴ steht, worin R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Alkylierungs- oder Acylierungsmitteln der allgemeinen Formeln (III), (IV), (V) oder (VI)

$$X-R^3$$
 (III) R^3 -CO-O-CO- R^3 (IV)

$$X-R^4$$
 (V) $R^4-CO-O-CO-R^4$ (VI)

5 in welchen

R3 und R4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können nach üblichen Methoden in andere Verbindungen der allgemeinen Formel (I) gemäß obiger Definition umgewandelt werden, beispielsweise durch Entacylierung mit Ammoniumacetat/Eisessig (R³/R⁴: -CO-CH₃ \rightarrow H) oder durch Addition von Hydrogensulfid (R²: CN \rightarrow CSNH₂).

Die neuen substituierten Aminouracile der allgemeinen Formel (I) zeichnen sich durch starke herbizide Eigenschaften aus.

In den Definitionen sind die gesättigten oder ungesättigten Kohlenwasserstoffketten, wie Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl, jeweils geradkettig oder verzweigt.

Halogen steht im allgemeinen für Fluor, Chlor, Brom oder Iod, vorzugsweise für Fluor, Chlor oder Brom, insbesondere für Fluor oder Chlor.

- 20 Gegenstand der Erfindung sind vorzugsweise Verbindungen der Formel (I), in welcher
 - R1 für Wasserstoff, Cyano, Fluor oder Chlor steht,
 - R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht,

- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl-carbonyl, Alkinyl oder Alkinylcarbonyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinyl-gruppen steht,
- R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylalkylcarbonyl mit jeweils 3 bis 8 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- Weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Welche jeweils gegebenenfalls durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes Arylcarbonyl oder Arylalkylcarbonyl mit 6 oder 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl steht,

- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl oder Alkinylcarbonyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinyl-gruppen steht,
- R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylalkylcarbonyl mit jeweils 3 bis 8 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁
- R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl steht, oder

- R⁴ zusammen mit R³ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Alkandiyl, Oxoalkandiyl oder Dioxoalkandiyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder für jeweils gegebenenfalls durch
 Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4
 Kohlenstoffatomen steht,
 - R⁶ für gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl mit i bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder C₁C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils bis zu 6
 Kohlenstoffatomen steht, und
 - R⁸ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht.
- 15 Die Erfindung betrifft insbesondere Verbindungen der Formel (I), in welcher
 - R¹ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
 - R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht,
- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy.
 Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl,
 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder
 t-Pentyl, Acetyl, n- oder i-Propyl-carbonyl, n-, i-, s- oder t-Butyl-carbonyl.
 Propenyl, Propenylcarbonyl, Butenyl, Butenylcarbonyl, Pentenylcarbonyl, Propinyl, Propinylcarbonyl, Butinyl, Butinylcarbonyl, Pentinyl
 oder Pentinylcarbonyl steht,
 - R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl oder Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder

i-Propoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclopentyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclobexylmethyl steht,

- S R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Phenylcarbonyl, Phenylmethylcarbonyl oder Phenylethylcarbonyl steht,
- weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxy-carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl steht,
- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Acetyl, n- oder i-Propyl-carbonyl, n-, i-, s- oder t-Butyl-carbonyl, Propenyl, Propenylcarbonyl, Butenylcarbonyl, Pentenylcarbonyl, Propinyl, Propinylcarbonyl, Butinyl, Butinylcarbonyl, Pentinyl oder Pentinylcarbonyl steht,
- weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl oder Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyclopropyl

butyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclohexyl, Cyclohexylcarbonyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl steht,

- R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro,

 Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder iPropyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iPropoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Phenylcarbonyl, Phenylmethylcarbonyl oder Phenylethylcarbonyl steht,
- R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxy-carbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl, steht, oder
 - zusammen mit R³ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen), 1-Oxo-propan-1,3-diyl, 1-Oxo-butan-1,4-diyl, 1,3-Dioxopropan-1,3-diyl oder 1,4-Dioxo-butan-1,4-diyl steht,
- 25 R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl steht,
 - für Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Chlordifluorethyl, Dichlorethyl, Dichlorethyl, Chlorfluorethyl, Chlordifluorethyl, Fluordichlorethyl, Trifluorethyl, Tetrafluorethyl, Chlortrifluorethyl oder Pentafluorethyl steht,

- R⁷ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i- oder s-Butoxy, Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl steht, und
- 5 R⁸ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i- oder s-Butoxy, Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl steht.
- Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen gelten sowohl für die Endprodukte der Formel (I) als auch entsprechend für die jeweils zur Herstellung benötigten Ausgangsstoffe bzw.
 Zwischenprodukte. Diese Restedefinitionen können untereinander, also auch zwischen den angegebenen bevorzugten Bereichen beliebig kombiniert werden.
- Beispiele für die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sind in den nachstehenden Gruppen aufgeführt.

Gruppe 1

R³ hat hierbei beispielhaft die in der nachstehenden Aufzählung angegebenen Bedeutungen:

Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Acetyl, n- oder i-Propyl-carbonyl, n-, i-, s- oder t-Butyl-carbonyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl-carbonyl, Difluoracetyl, Trifluoracetyl, Chlordifluoracetyl, Fluordichloracetyl, Fluorpropionyl, Chlorpropionyl, Chlorpropionyl, Difluor-

propionyl, Dichlorpropionyl, Trifluorpropionyl, Trichlorpropionyl, Chlordifluorpropionyl, Tetrafluorpropionyl, Chlortrifluorpropionyl, Pentafluorpropionyl, Fluorbutyroyl, Chlorbutyroyl, Difluorbutyroyl, Dichlorbutyroyl, Trifluorbutyroyl, Cyanomethyl, Cyanoacetyl, Cyanoethyl, Cyanopropionyl, Cyanopropyl, Cyanobutyroyl, Carboxymethyl, Carboxyethyl, Carboxypropyl, Carboxybutyl, Methoxymethyl, 5 Methoxyacetyl, Ethoxymethyl, Ethoxyacetyl, Propoxymethyl, Propoxyacetyl, Methoxyethyl, Methoxypropionyl, Ethoxyethyl, Propoxyethyl, Methoxypropyl, Methoxybutyroyl, Ethoxypropyl, Ethoxybutyroyl, Methoxycarbonylmethyl, Ethoxycarbonylmethyl, Propoxycarbonylmethyl, Methoxycarbonylethyl, Ethoxycarbonylethyl, Propoxycarbonylethyl, Methoxycarbonylpropyl, Ethoxycarbonylpropyl, 1-10 Propen-3-yl (Allyl), 3-Methyl-1-propen-3-yl, 2-Buten-4-yl (Crotonyl), 1-Propin-3yl (Propargyl), 3-Methyl-1-propin-3-yl, 2-Butin-4-yl, Cyclopropyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyanocyclopropyl, Carboxycyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Dichlorcyclopropyl, Methylcyclopropyl, Methoxycarbonylcyclopropyl, Ethoxycarbonylcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyanocyclobutyl, Carboxycyclo-15 butyl, Difluorcyclobutyl, Difluorcyclobutylcarbonyl, Trifluorcyclobutyl, Trifluorcyclobutylcarbonyl, Tetrafluorcyclobutyl, Tetrafluorcyclobutylcarbonyl, Chlortrifluorcyclobutyl, Chlortrifluorcyclobutylcarbonyl, Methylcyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyanocyclopentyl, Carboxycyclopentyl, Fluorcyclopentyl, Chlorcyclopentyl, Difluorcyclopentyl, Dichlorcyclopentyl, Methylcyclopentyl, 20 Methoxycarbonylcyclopentyl, Ethoxycarbonylcyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexylcarbonyl, Cyanocyclohexyl, Carboxycyclohexyl, Fluorcyclohexyl, Chlorcyclohexyl, Difluorcyclohexyl, Dichlorcyclohexyl, Methylcyclohexyl, Trifluormethylcyclohexyl, Methoxycarbonylcyclohexyl, Ethoxycarbonylcyclohexyl, Cyclopropyl-25 methyl, Difluorcyclopropylmethyl, Dichlorcyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyanocyclohexylmethyl, Carboxycyclohexylmethyl, Fluorcyclohexylmethyl, Chlorcyclo-hexylmethyl, Methylcyclohexylmethyl, Trifluormethylcyclohexylmethyl, Benzoyl, Cyanobenzoyl, Nitrobenzoyl, Fluorbenzoyl, Chlorbenzoyl, Brombenzoyl, Methylbenzoyl, Trifluormethylbenzoyl, Methoxybenzoyl, Difluormethoxybenzoyl, Trifluormethoxybenzoyl, Phenylacetyl, 30 Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Pyridylcarbonyl.

- 11 -

Gruppe 2

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 3

5

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 4

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 5

 ${\rm R}^3$ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 6

5

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 7

 ${\rm R}^3$ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

- 13 -

Gruppe 8

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 9

5

 ${\bf R^3}$ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Gruppe 10

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

10

15

20

Gruppe 11

R³ hat hierbei beispielhaft die oben in Gruppe 1 aufgeführten Bedeutungen.

Verwendet man beispielsweise 3-Amino-4-chlordifluormethyl-1-(4-cyano-2-fluor-5-methylsulfonylamino-phenyl)-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin und Dichloracetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Reaktionsablauf beim erfindungsgemäßen Verfahren durch das folgende Formelschema skizziert werden:

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) als Ausgangsstoffe zu verwendenden Aminouracile sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In der Formel (II) haben R^1 , R^2 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben bei der Beschreibung der erfindungsgemäß herzustellenden Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R^1 , R^2 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 angegeben wurden; Z steht vorzugsweise für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C_1 - C_4 -Alkylsulfonylamino, Amino oder gegebenenfalls durch Halogen substituiertes C_1 - C_4 -Alkyl-carbonylamino, insbesondere für Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino oder Trifluoracetylamino.

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. EP 408382, EP 648749).

Die beim erfindungsgemäßen Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) weiter als Ausgangsstoffe zu verwendenden Alkylierungs- oder Acylierungsmittel sind durch die Formeln (III), (IV), (V) und (VI) allgemein definiert. In diesen Formeln haben R³ und R⁴ vorzugsweise bzw. insbesondere diejenigen Bedeutungen, die bereits oben bei der Beschreibung der erfindungsgemäß herzustellenden Verbindungen der Formel (I) vorzugsweise bzw. als insbesondere bevorzugt für R³ und R⁴ angegeben wurden.

Die Ausgangsstoffe der Formeln (III), (IV), (V) und (VI) sind bekannte Synthesechemikalien.

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) 10 wird vorzugsweise in Gegenwart eines geeigneten Reaktionshilfsmittels durchgeführt. Als Reaktionshilfsmittel kommen im allgemeinen die üblichen anorganischen oder organischen Basen oder Säureakzeptoren in Betracht, Hierzu gehören vorzugsweise Alkalimetall- oder Erdalkalimetall- -acetate, -amide, -carbonate, -hydrogencarbonate, -hydride, -hydroxide oder -alkanolate, wie beispielsweise Na-15 trium-, Kalium- oder Calcium-acetat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calciumamid, Natrium-, Kalium- oder Calcium-carbonat, Natrium-, Kalium- oder Calciumhydrogencarbonat, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydrid, Lithium-, Natrium-, Kalium- oder Calcium-hydroxid, Natrium- oder Kalium- -methanolat, -20 ethanolat, n- oder i-propanolat, n-, i-, s- oder t-butanolat; weiterhin auch basische organische Stickstoffverbindungen, wie beispielsweise Trimethylamin, Triethylamin, Tripropylamin, Tributylamin, Ethyl-diisopropylamin, N,N-Dimethyl-cyclohexylamin, Dicyclohexylamin, Ethyl-dicyclohexylamin, N,N-Dimethyl-anilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, 2-Methyl-, 3-Methyl-, 4-Methyl-, 2,4-Dimethyl-, 25 2,6-Dimethyl-, 3,4-Dimethyl- und 3,5-Dimethyl-pyridin, 5-Ethyl-2-methyl-pyridin, 4-Dimethylamino-pyridin, N-Methyl-piperidin, 1,4-Diazabicyclo[2,2,2]-octan (DABCO), 1,5-Diazabicyclo[4,3,0]-non-5-en (DBN), und 1,8 Diazabicyclo[5,4,0]undec-7-en (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) wird vorzugsweise in Gegenwart eines Verdünnungsmittels durchgeführt. Als Verdünnungsmittel kommen im allgemeinen die üblichen organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische und aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Pentan, Hexan, Heptan, Petrolether, Ligroin, Benzin, Benzol, Toluol, Xylol, Chlorbenzol,

10

15

20

Dichlorbenzol, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Dichlormethan (Methylenchlorid), Trichlormethan (Chloroform) oder Tetrachlormethan, Dialkylether, wie beispielsweise Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether (MTBE), Ethyl-t-butylether, Methyl-t-pentylether (TAME), Ethyl-t-pentylether, Tetrahydrofuran (THF), 1,4-Dioxan, Ethylenglycol-dimethylether oder -diethylether, Diethylenglycol-dimethylether oder -diethylether; Dialkylketone, wie beispielsweise Aceton, Butanon (Methylethylketon), Methyl-i-propylketon oder Methyl-i-butylketon, Nitrile, wie beispielsweise Acetonitril, Propionitril, Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie beispielsweise N,N-Dimethyl-formamid (DMF), N,N-Dimethyl-acetamid, N-Methyl-formanilid, N-Methyl-pyrrolidon oder Hexamethyl-phosphorsäuretriamid; Ester, wie beispielsweise Essigsäure-methylester, -ethylester, -n- oder -i-propylester, -n-, -i- oder -s-butylester; Sulfoxide, wie beispielsweise Dimethylsulfoxid; Alkanole, wie beispielsweise Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, s- oder t-Butanol, Ethylenglycol-monomethylether oder -monoethylether, Diethylenglycolmonomethylether oder -monoethylether; deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 150°C, vorzugsweise zwischen 10°C und 120°C.

Das erfindungsgemäße Verfahren wird im allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, das erfindungsgemäße Verfahren unter erhöhtem oder vermindertem Druck - im allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar - durchzuführen.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens werden die Ausgangsstoffe im allgemeinen in angenähert äquimolaren Mengen eingesetzt. Es ist jedoch auch möglich, eine der Komponenten in einem größeren Überschuß zu verwenden. Die Umsetzung wird im allgemeinen in einem geeigneten Verdünnungsmittel in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels durchgeführt und das Reaktionsgemisch wird im allgemeinen mehrere Stunden bei der erforderlichen Temperatur gerührt. Die Aufarbeitung wird nach üblichen Methoden durchgeführt (vgl. die Herstellungsbeispiele).

20

30

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als Defoliants, Desiccants, Krautabtötungsmittel und insbesondere als Unkrautvernichtungsmittel verwendet werden. Unter Unkraut im weitesten Sinne sind alle Pflanzen zu verstehen, die an Orten aufwachsen, wo sie unerwünscht sind. Ob die erfindungsgemäßen Stoffe als totale oder selektive Herbizide wirken, hängt im wesentlichen von der angewandten Menge ab.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können z.B. bei den folgenden Pflanzen verwendet werden:

Dikotyle Unkräuter der Gattungen: Sinapis, Lepidium, Galium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Solanum, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Galeopsis, Papaver, Centaurea, Trifolium, Ranunculus, Taraxacum.

Dikotyle Kulturen der Gattungen; Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis, Cucurbita.

Monokotyle Unkräuter der Gattungen: Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monochoria, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Sphenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus, Apera.

Monokotyle Kulturen der Gattungen: Oryza, Zea, Triticum, Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus, Allium.

Die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe ist jedoch keineswegs auf diese Gattungen beschränkt, sondern erstreckt sich in gleicher Weise auch auf andere Pflanzen.

Die Verbindungen eignen sich in Abhängigkeit von der Konzentration zur Totalunkrautbekämpfung z.B. auf Industrie- und Gleisanlagen und auf Wegen und Plätzen mit und ohne Baumbewuchs. Ebenso können die Verbindungen zur

15

20

25

30

Unkrautbekämpfung in Dauerkulturen, z.B. Forst, Ziergehölz-, Obst-, Wein-, Citrus-, Nuß-, Bananen-, Kaffee-, Tee-, Gummi-, Ölpalm-, Kakao-, Beerenfrucht- und Hopfenanlagen, auf Zier- und Sportrasen und Weideflächen und zur selektiven Unkrautbekämpfung in einjährigen Kulturen eingesetzt werden.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) eignen sich insbesondere zur selektiven Bekämpfung von monokotylen und dikotylen Unkräutern in monokotylen Kulturen sowohl im Vorauflauf- als auch im Nachauflauf-Verfahren.

Die Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage: z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie

Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln; als Emulgier-und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fett-alkohol-Ether, z.B. Alkylarylpolyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate; als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet
werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche
Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine und synthetische Phospholipide.
Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Herbiziden zur Unkrautbekämpfung Verwendung finden, wobei Fertigformulierungen oder Tankmischungen möglich sind.

Für die Mischungen kommen bekannte Herbizide in Frage, beispielsweise Anilide, wie z.B. Diflufenican und Propanil; Arylcarbonsäuren, wie z.B. Dichlorpicolinsäure, Dicamba und Picloram; Aryloxyalkansäuren, wie z.B. 2,4 D, 2,4 DB, 2,4 DP, Fluroxypyr, MCPA, MCPP und Triclopyr; Aryloxy-phenoxy-alkansäureester, wie z.B. Diclofop-methyl, Fenoxaprop-ethyl, Fluazifop-butyl, Haloxyfop-methyl und Quizalofop-ethyl; Azinone, wie z.B. Chloridazon und Norflurazon; Carbamate, wie z.B. Chlorpropham, Desmedipham, Phenmedipham und Propham; Chloracetanilide, wie z.B. Alachlor, Acetochlor, Butachlor, Metazachlor, Metolachlor, Pretilachlor und Propachlor; Dinitroaniline, wie z.B. Oryzalin, Pendimethalin und Trifluralin; Diphenylether, wie z.B. Acifluorfen, Bifenox, Fluoroglycofen, Fome-

safen, Halosafen, Lactofen und Oxyfluorfen, Harnstoffe, wie z.B. Chlortoluron, Diuron, Fluometuron, Isoproturon, Linuron und Methabenzthiazuron; Hydroxylamine, wie z.B. Alloxydim, Clethodim, Cycloxydim, Sethoxydim und Tralkoxydim; Imidazolinone, wie z.B. Imazethapyr, Imazamethabenz, Imazapyr und Imazaquin; Nitrile, wie z.B. Bromoxynil, Dichlobenil und Ioxynil; Oxyacetamide, 5 wie z.B. Mefenacet; Sulfonylharnstoffe, wie z.B. Amidosulfuron, Bensulfuronmethyl, Chlorimuron-ethyl, Chlorsulfuron, Cinosulfuron, Metsulfuron-methyl, Nicosulfuron, Primisulfuron, Pyrazosulfuron-ethyl, Thifensulfuron-methyl, Triasulfuron und Tribenuron-methyl; Thiolcarbamate, wie z.B. Butylate, Cycloate, Diallate, EPTC, Esprocarb, Molinate, Prosulfocarb, Thiobencarb und Triallate; 10 Triazine, wie z.B. Atrazin, Cyanazin, Simazin, Simetryne, Terbutryne und Terbutylazin; Triazinone, wie z.B. Hexazinon, Metamitron und Metribuzin; Sonstige, wie z.B. Aminotriazol, Benfuresate, Bentazone, Cinmethylin, Clomazone, Clopyralid, Difenzoquat, Dithiopyr, Ethofumesate, Fluorochloridone, Glufosinate, Glyphosate, Isoxaben, Pyridate, Quinchlorac, Quinmerac, Sulphosate und Tridiphane.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Fungiziden, Insektiziden, Akariziden, Nematiziden, Schutzstoffen gegen Vogelfraß, Pflanzennährstoffen und Bodenstrukturverbesserungsmitteln ist möglich.

- 20 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus durch weiteres Verdünnen bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Emulsionen, Pulver, Pasten und Granulate angewandt werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Spritzen, Sprühen, Streuen.
- 25 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können sowohl vor, als auch nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Sie können auch vor der Saat in den Boden eingearbeitet werden.

Die angewandte Wirkstoffmenge kann in einem größeren Bereich schwanken. Sie hängt im wesentlichen von der Art des gewünschten Effektes ab. Im allgemeinen 30 liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche, vorzugsweise zwischen 5 g und 5 kg pro ha.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den nachfolgenden Beispielen hervor.

10

Herstellungsbeispiele:

Beispiel 1

Eine Mischung aus 2,1 g (5 mMol) 3-Amino-1-(4-cyano-2-fluor-5-ethylsulfonyl-amino-phenyl)-5-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin, 1,1 g (5,5 mMol) Trifluoressigsäureanhydrid, 1 ml Triethylamin und 20 ml Acetonitril wird 30 Stunden unter Rückfluß erhitzt und anschließend mit Wasserstrahlvakuum eingeengt. Der Rückstand wird in Essigsäureethylester aufgenommen, mit 1N-Salzsäure gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und filtriert. Das Filtrat wird im Wasserstrahlvakuum eingeengt und das als Rückstand erhaltene Rohprodukt durch Säulenchromatographie (Kieselgel, Chloroform/Essigsäureethylester, Vol. 1:1) gereinigt.

Man erhält 0,8 g (38% der Theorie) 3-Amino-1-(4-cyano-2-fluor-5-trifluoracetylamino-phenyl)-5-trifluormethyl-3,6-dihydro-2,6-dioxo-1(2H)-pyrimidin.

15 ¹H-NMR (Dimethylsulfoxid-D6, δ): 6,47 ppm.

Analog Beispiel 1 sowie entsprechend der allgemeinen Beschreibung des erfindungsgemäßen Herstellungsverfahrens können beispielsweise auch die in der nachstehenden Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen der Formel (I) hergestellt werden.

Tabelle 1: Beispiele für die Verbindungen der Formel (I)

Bsp Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸	Physikal. Daten
2	F	CN	Н	Н	Н	CF ₃	Н	Н	
3	F .	CN	Н	CH ₃	Н	CF ₃	Н	H	
4	F	CN	CH ₃	CH ₃	Н	CF ₃	H	Н	
5	F	CN	CH ₃	$C_3H_{\mathcal{T}}i$	Н	CF ₃	Н	H	
6	F	CN	Н	C_2H_5	H	CF ₃	Н	H	
7	F	CN	Н	C ₃ H ₇ -n	Н	CF ₃	Н	Н	
8	F	CN	Н	C ₃ H ₇ -i	H	CF ₃	Н	Н	
9	F	CN	-	(CH ₂) ₄ -	H	CF ₃	Н	H	
10	F	CN	Н	COCF ₃	H	CF ₃	Н	H	
11	F	CN	H	COC ₂ F ₅	Н	CF ₃	Н	H	
12	F	CN	H	COCH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	
13	F	CN	COCH ₃	COCH ₃	Н	CF ₃	Н	H	
14	F	CN	-CO-(CH₂CH₂-CO-	Н	CF ₃	Н	Н	
15	F	CN	н	COC ₂ H ₅	Н	ÇF ₃	Н	Н	

Bsp Nr.	R1	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Physikal. Daten
16	F	CN	Н		Н	CF ₃	Н	Н	
17	F	CN	н	s	н	CF ₃	Н	Н	
18	F	CN	н	O	Н	CF ₃	Н	Н	
19	F	CN	Н	COC ₄ H ₉ -t	Н	CF ₃	Н	н	
20	F	CN	Н	COC ₃ H ₇ -i	Н	CF ₃	Н	H	
21	F	CN	CH ₃	COCH ₃	H	CF ₃	Н	Н	
22	F	CN	C ₂ H ₅	COC ₄ H ₉ -n	н	CF ₃	н	Н	
23	F	CN	CH ₃	COCF ₃	Н	CF ₃	H	Н	
24	F	CN	COCH ₃	11	H	CF ₃	Н	Н	
25	F	CN	Н	CH ₂ COOCH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	
26	F	CN .	CH ₃	CH ₂ COOCH ₃	Н	CF ₃	Н	Н	
27	F	CN	COCH ₃	CH ₂ CN	Н	CF ₃	Н	Н	
28	F	CN	H	CH ₂ CH ₂ CN	H	CF ₃	Н	Н	
29	F	CSNH ₂	H	COCF ₃	Н	CF ₃	Н	Н	

Bsp Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	Physikal. Daten
30	F	CN	Н	COCHCI ₂	H	CF ₃	Н	Н	
31	F	CN			Н	CF ₃	Н	Н	
32	F	CN		CF ₃ O	H	CF ₃	Н	H	
33	F	CN	Н	CH ₃	Н	CF ₃	CH ₃	н	
34	F	CSNH ₂	Н	CH ₃	Н	CF ₃	_	Н	
35	F	CN	Н		Н	CF ₃	н	Н	

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

Pre-emergence-Test

Lösungsmittel:

5 Gewichtsteile Aceton

5 Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

- Samen der Testpflanzen werden in normalen Boden ausgesät. Nach ca. 24 Stunden wird der Boden mit der Wirkstoffzubereitung begossen. Dabei hält man die Wassermenge pro Flächeneinheit zweckmäßigerweise konstant. Die Wirkstoffkonzentration in der Zubereitung spielt keine Rolle, entscheidend ist nur die Aufwandmenge des Wirkstoffs pro Flächeneinheit.
- Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

Es bedeuten:

0 %

keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)

100 %

totale Vernichtung

In diesem Test zeigt beispielsweise die Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel 1 bei sehr guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Mais (0 %), bei einer Aufwandmenge von 30 g/ha sehr starke Wirkung gegen Unkräuter wie Setaria (100 %), Sorghum (90 %), Abutilon (100 %), Galium (100 %), Matricaria (100 %) sowie Polygonum (100 %).

Beispiel B

Post-emergence-Test

Lösungsmittel:

5 Gewichtsteile Aceton

Emulgator:

l Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Mit der Wirkstoffzubereitung spritzt man Testpflanzen, welche eine Höhe von 5 - 15 cm haben so, daß die jeweils gewünschten Wirkstoffmengen pro Flächeneinheit ausgebracht werden. Die Konzentration der Spritzbrühe wird so gewählt, daß in 1000 l/ha die gewünschten Wirkstoffmengen ausgebracht werden.

Nach drei Wochen wird der Schädigungsgrad der Pflanzen bonitiert in % Schädigung im Vergleich zur Entwicklung der unbehandelten Kontrolle.

15 Es bedeuten:

0 % = keine Wirkung (wie unbehandelte Kontrolle)
100 % = totale Vernichtung

In diesem Test zeigt beispielsweise die Verbindung gemäß Herstellungsbeispiel 1 bei sehr guter Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen, wie z.B. Weizen (0 %) und einer Aufwandmenge von 30 g/ha sehr starke Wirkung gegen Unkräuter wie Echinochloa (100 %), Abutilon (100 %), Datura (100 %), Ipomoea (100 %) sowie Viola (100 %).

Patentansprüche

1. Substituierte Aminouracile der allgemeinen Formel (I)

in welcher

10

15

5 R¹ für Wasserstoff, Cyano oder Halogen steht,

R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht,

- R³ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl oder Heterocyclylcarbonyl steht,
- für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylcarbonyl, Cycloalkylalkyl, Cycloalkylalkylcarbonyl, Arylcarbonyl, Arylalkylcarbonyl oder Heterocyclylcarbonyl steht, oder zusammen mit R³ für jeweils gegebenenfalls substituiertes Alkandiyl, Oxoalkandiyl oder Dioxoalkandiyl steht,
- R⁵ für Wasserstoff, Halogen oder jeweils gegebenenfalls substituiertes
 Alkyl oder Alkoxy steht,
 - R⁶ für gegebenenfalls substituiertes Alkyl steht,

- R⁷ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl steht, und
- R⁸ für Wasserstoff oder für einen jeweils gegebenenfalls substituierten Rest der Reihe Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl steht.
- Substituierte Aminouracile der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
 - R1 für Wasserstoff, Cyano, Fluor oder Chlor steht,
 - R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht,
 - für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl oder Alkinylcarbonyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylgruppen steht,
- weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyl-carbonyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylalkylcarbonyl mit jeweils 3 bis 8 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
 - weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes Arylcarbonyl oder Arylalkylcarbonyl mit 6 oder 10 Kohlenstoff-

10

15

20

25

atomen im Arylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

- R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl steht,
 - für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkenyl, Alkenylcarbonyl, Alkinyl oder Alkinylcarbonyl mit jeweils bis zu 10 Kohlenstoffatomen in den Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylgruppen steht,
 - weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkyl-carbonyl, Cycloalkylalkyl oder Cycloalkylalkylcarbonyl mit jeweils 3 bis 8 Kohlenstoffatomen im Cycloalkylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,
- weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro,
 Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl,

 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind),
 durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenen-

falls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluor-methyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes Arylcarbonyl oder Arylalkylcarbonyl mit 6 oder 10 Kohlenstoffatomen im Arylteil und gegebenenfalls bis zu 4 Kohlenstoffatomen im Alkylteil steht,

5

R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, durch C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkyl-carbonyl oder C₁-C₄-Alkoxy-carbonyl (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiert sind), durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio (welche jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl und/oder Trifluormethoxy substituiert sind) substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl steht, oder

15

10

R⁴ zusammen mit R³ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Brom, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Alkandiyl, Oxoalkandiyl oder Dioxoalkandiyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht,

20

R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit jeweils 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht.

25

R⁶ für gegebenenfalls durch Fluor und/oder Chlor substituiertes Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

30

R⁷ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht, und

15

- R⁸ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder C₁-C₄-Alkoxy substituiertes Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit jeweils bis zu 6 Kohlenstoffatomen steht.
- Substituierte Aminouracile der allgemeinen Formel (I) gemäß Anspruch 1,
 dadurch gekennzeichnet, daß
 - R¹ für Wasserstoff, Fluor oder Chlor steht,
 - R² für Cyano oder Thiocarbamoyl steht,
- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxy-carbonyl, substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Acetyl, n- oder i-Propyl-carbonyl, n-, i-, s- oder t-Butyl-carbonyl, Propenyl, Propenyl-carbonyl, Butenyl, Butenylcarbonyl, Pentenyl, Pentenylcarbonyl, Propinyl, Propinylcarbonyl, Butinyl, Butinylcarbonyl, Pentinyl oder Pentinylcarbonyl steht,
 - R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl oder Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclohexyl, Cyclohexylcarbonyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl steht,
- 25 R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl sub-

10

25

30

stituiertes Phenylcarbonyl, Phenylmethylcarbonyl oder Phenylethylcarbonyl steht,

- R³ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, noder i-Propoxycarbonyl, durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Isoxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl steht,
- für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano,
 Carboxy, Fluor, Chlor, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Acetyl,
 Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl, substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, soder t-Butyl, n-, i-, s- oder t-Pentyl, Acetyl, n- oder i-Propylcarbonyl, n-, i-, s- oder t-Butyl-carbonyl, Propenyl, Propenyl,
 Butenyl, Butenyl, Butenyl, Pentenyl, Pentenyl, Pentenyl,
 Propinyl, Propinylcarbonyl, Butinyl, Butinylcarbonyl, Pentinyl oder
 Pentinylcarbonyl steht,
 - R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, noder i-Propoxy, Acetyl oder Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylcarbonyl, Cyclobutyl, Cyclobutylcarbonyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Cyclopentylcarbonyl, Cyclopentyl, Cyclopentylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl oder Cyclohexylmethyl steht,
 - R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Nitro, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Trifluormethyl, Methoxy,

Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n- oder i-Propoxycarbonyl substituiertes Phenylcarbonyl, Phenylmethylcarbonyl oder Phenylethylcarbonyl steht,

5

R⁴ weiterhin für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, noder i-Propyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Methylthio, Ethylthio, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Acetyl, Propionyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, noder i-Propoxycarbonyl, durch Phenyl, Phenoxy oder Phenylthio substituiertes Furylcarbonyl, Tetrahydrofurylcarbonyl, Thienylcarbonyl, Tetrahydrothienylcarbonyl, Oxazolylcarbonyl, Thiazolylcarbonyl, Oxadiazolylcarbonyl, Thiadiazolylcarbonyl, Pyrazolylcarbonyl, Pyridinylcarbonyl oder Pyrimidinylcarbonyl, steht, oder

15

10

R⁴ zusammen mit R³ für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl substituiertes Propan-1,3-diyl (Trimethylen), Butan-1,4-diyl (Tetramethylen), 1-Oxo-propan-1,3-diyl, 1-Oxo-butan-1,4-diyl, 1,3-Dioxopropan-1,3-diyl oder 1,4-Dioxobutan-1,4-diyl steht.

20

R⁵ für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl steht,

25

R⁶ für Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluormethyl, Fluordichlormethyl, Chlorethyl, Fluorethyl, Dichlorethyl, Dichlorethyl, Chlorfluorethyl, Chlordifluorethyl, Fluordichlorethyl, Trifluorethyl, Tetrafluorethyl, Chlortrifluorethyl oder Pentafluorethyl steht,

30

R⁷ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i- oder s-Butoxy, Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl steht, und

- R⁸ für Wasserstoff oder für jeweils gegebenenfalls durch Fluor, Chlor, Methoxy oder Ethoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, n-, i- oder s-Butoxy, Propenyl, Butenyl, Propinyl oder Butinyl steht.
- Verfahren zur Herstellung substituierter Aminouracile der allgemeinen Formel (I)

in welcher

10

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die in Anspruch 1 genannten Bedeutungen haben,

dadurch gekennzeichnet, daß man Aminouracile der allgemeinen Formel (II)

in welcher

15 R¹, R², R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

Z für gegebenenfalls substituiertes Alkylsulfonylamino oder die Gruppierung NR³R⁴ steht, worin R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Alkylierungs- oder Acylierungsmitteln der allgemeinen Formeln (III), (IV), (V) oder (VI)

R^3 -CO-O-CO- R^3	(IV)
	R ³ -CO-O-CO-R ³

$$X-R^4$$
 (V) $R^4-CO-O-CO-R^4$ (VI)

in welchen

R3 und R4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

- gegebenenfalls in Gegenwart eines Reaktionshilfsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.
 - 5. Herbizide Mittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem substituierten Aminouracil der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4.
- Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte Aminouracile der allgemeinen Formel (I) gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 auf unerwünschte Pflanzen und/oder ihren Lebensraum einwirken läßt.
- 7. Verwendung von substituierten Aminouracilen der allgemeinen Formel (I)
 20 gemäß der Ansprüche 1 bis 4 zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzen.
- Verfahren zur Herstellung von herbiziden Mitteln, dadurch gekennzeichnet, daß man substituierte Aminouracile der allgemeinen Formel (I) gemäß der Ansprüche 1 bis 4 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Substanzen vermischt.



中华人民共和国国家知识产权局

dat ind	 【编码:		发文日期:
I MP PS		中国生利华河(圣姓)大型八马	
		中国专利代理(香港)有限公司	
	杳	港湾仔港湾道 23 号鹰君中心 22 字楼	1 3 3
		张元忠 杨丽琴	(2) 1 3 - 1 - 1
ф	请 号:	98812711.3	i
<u> </u>			
中	请 人:	ISK 美国有限公司	
发	明名称:	取代的苯化合物、它们的制备方法和含它们	的除草剂和脱叶剂组合物
		第一次审查意见通知书	00608929
		(进入国家阶段的 PCT 申请)	0000017
ı. 🛭	依申请人提出	的实审请求,根据专利法第35条第1款的规定,审查员对上。	述 发明专利申请进行实质审查。
	】根据专利法第	35 条第 2 欧的规定,国家知识产权局决定自行对上述发明专利	可申请进行审查。
2. 🛚	申谐人要求以	其在:	
	美国	专利局的申请日 <u>1997.10.27</u> 为优先权日,	
		专利局的申请日为优先权日,	
		专利局的申请日为优先权日,	
3. [〕申请人于	_年	51条的规定。
	〕申请人提交的	下列修改文件不符合专利法第 33 条的规定:	
	□ 国际初步	审查报告附件的中文译文。	
		合作条约第 19 条规定所提交的修改文件的中文详文。	
•	□ 依据专利	合作条约第 28 条或 41 条规定所提交的修改文件。	
1. 🛛	审查是针对原	始提交的国际申请的中文译文进行的。	
	市査是针对下	述申请文件进行的:	
	说明书	第页,按照原始提交的国际申请文件的中文译文;	
		第页,按照国际初步市查报告附件的中文译文:	0 3 AUG 2004
		第页,按照依据专利合作条约第 28 条或 41 条规定所提	交的修改文件:
		第页,按照依据专利法实施细则第51规定所提交的修改	文文件。
	权利要求	第项,按照原始提交的国际申请文件的中文译文:	
		第项,按照依据专利合作条约第 19 条规定所提交的修改	文文件的中文译文。
		第项、按照国际初步审查报告附件的中文译文:	
		第项,按照依据专利合作条约第28条或41条所提交的	修改文件:
		第项,按照依据专利法实施组则第51条规定所提交的模	
	附图	第二二页,按照原始提出的国际申请文件的中文译文;	1.3
		第页,按照国际初步市查报告附件的中文译文;	A STATE OF THE STA
		第页,按照依据专利合作条约第 28 条或 41 条所提交的 第页,按照依据专利法实施细则第 51 条规定所提交的修	



中华人民共和国国家知识产权局

5. 🛛	本通知书引用下述对比文献 (其编号在今后的审查过程中继续沿用):	
编号	义件号或名称	公 开 日 期 (或抵触申谓的申请日)
1	EP0705829A1	1996.04.10
2	WO9709319A1	1997.03.13
6. 审		
] 关于说明书:	
	申请的内容属于专利法第5条规定的不授予专利权的范围。	
	□ 说明书不符合专利法第 33 条的规定。	
	□ 说明书的撰写不符合专利法实施纠则第 18 条的规定。	
\boxtimes	】关于权利要求书:	
	☑ 权利要求 1-4,7-11 不具备专利法第22条第2款规定的新颖性。	
	○ 权利要求 1··14 不具备专利法第 22 条第 3 款规定的创造性。	
	□ 权利要求不具备专利法第 22 条第 4 款规定的实用性。	
	○ 权利要求 1, 5, 13, 14 不符合专利法第 26 条第 4 款的规定。	
	○ 权利要求 1.13,14,15 不符合专利法第 31 条第 1 款的规定。	
	L 权利要求不符合专利法第 33 条的规定。	
	□ 权利要求	11) A.
	□ 权利要求不符合专利法实施组则第2条第1款关于发明的定义的	规定。
		-
Jr.	述结论性意见的具体分析见本通知书的正文部分。	
7. 書	于上述结论性意见,审查员认为:	
] 申请人应按照通知书正文部分提出的要求,对申请文件进行修改。	
] 申请人应在意见陈述书中论述其专利申请可以被授予专利权的理由,并对通知	D 书正文部分中指出的不符合规定之 如
K-	进行修改,否则将不能授予专利权。	and the state of t
×	】专利申请中没有可以被授予专利权的实质性内容,如果申请人没有陈述理由或 ¬	者陈还理田小允分, 具甲硝将极级四。
ـا ه	J ese Letentore T24 市区	
	B诺人应注意下述事项: (1) 根据专利法第 37 条的规定,申请人应在收到本通知书之目起的 <u>、肆</u> 个力	3.内脏迷音见 加思电读人于正当现成
	(1) 根据专利法第37条的规定,中国人应住权到本地对它自己的 <u>并</u> 17 逾期不答复,其申谐将被视为撤回。	17内队处态光,如未中仍人无正当注证
	(2) 申请人对其申请的修改应符合专利法第 33 条的规定,修改文本应一式两份	,北及北心符会审查指南的有关规定
	(3) 申请人的意见陈述书和/或修改文本应邮寄或递交给中国专利局受理处,户	
	法律效力。	
	(4) 未经预约,申请人和/或代理人不得前来中国专利局与审查员举行会略。	
	x 通知书正文部分共有 4 页, 升附有下述附件:	
	□ 引用的对比文件的复印件共 2.份页。	
审	查八部二室 审查员签 7 回转 10 10 10 10 10 10 10 10 10 10 10 10 10	完成日期:2004-03-04

CPCH0060892P

Patent Office of the People's Republic of China

Address: Receiving Section of the Chinese Patent Office, No. 6 Tucheng Road West, Haidian District, Beijing. Postal code: 100088

Applicant	IISK AMERICAS INCORPORATED	Seal of Examiner	Date of Issue
Agent	China Patent Agent (H.K.) Ltd.		March 19, 2004
Patent Application No.	98812711.3 Application August 21, 1998	Exam Dept,	
PRE	SSTITUTED BENZENE COMPOUND, PROCE PARATION, AND HERBICIDAL AND DEFOL NTAINING THEM		

First Office Action
(PCT application entering into the national phase)
 ☑ Under the provision of Art. 35, para. 1 of the Patent Law, the examiner has made an examination as to substance of the captioned patent application for invention upon the request for substantive examination filed by the applicant.
□ Under the provision of Art. 35, para. 2 of the Patent Law, the Chinese Patent Office has decided to conduct an examination of the captioned patent application for invention on its own initiative.
2. ☑ The applicant requests that
the filing date <u>October 27, 1997</u> at the <u>US</u> Patent Office be taken as the priority date of the present application,
the filing date at the Patent Office be taken as the priority date of the present application,
the filing date at the Patent Office be taken as the priority date of the present application.
3. The following amended documents submitted by the applicant cannot be accepted for failure to conform with Art. 33 of the Patent Law:
☐ the Chinese version of the annex to the international preliminary examination report. ☐ the Chinese version of the amended documents submitted according to the
provision of Rule 19 of the Patent Cooperation Treaty.
☐ the amended documents submitted according to the provision of Rule 28 or Rule 41

	of the Patent Cooperation freaty.
	the amended documents submitted according to the provision of Rule 51 of the
	Implementing Regulations of the Patent Law.
	See the text portion of this Office Action for detailed reasons why the amendment cannot be accepted.
4	To Every in which is constructed on the Chinese various of the initially submitted
4.	☑ Examination is conducted on the Chinese version of the initially-submitted international application.
	☐ Examination is conducted on the following document(s):
	\square page of the description, based on the Chinese version of the initially-
	submitted international application documents;
	page of the description, based on the Chinese version of the annex to the international preliminary examination report;
	page of the description, based on the amended documents submitted
	according to the provision of Rule 28 or Rule 41 of the Patent Cooperation Treaty;
	page of the description, based on the amended documents submitted
	according to the provision of Rule 51 of the Implementing Regulations of the Patent
	Law.
	\square claim(s) , based on the Chinese version of the initially-submitted
	international application documents;
	claim(s), based on the Chinese version of the amended documents
	submitted according to the provision of Rule 19 of the Patent Cooperation Treaty;
	claim(s), based on the Chinese version of the annex to the international
	preliminary examination report;
	claim(s), based on the amended documents submitted according to the
	provision of Rule 28 or Rule 41 of the Patent Cooperation Treaty;
	claim(s), based on the amended documents submitted according to the
	provision of Rule 51 of the Implementing Regulations of the Patent Law.
	\square Fig(s) , based on the Chinese version of the initially-submitted international
	application documents;
	Fig(s), based on the Chinese version of the annex to the international
	preliminary examination report;
	Fig(s), based on the amended documents submitted according to the
	provision of Rule 28 or Rule 41 of the Patent Cooperation Treaty;
	Fig(s), based on the amended documents submitted according to the
	provision of Pule 51 of the Implementing Regulations of the Patent Law

5. If The following reference document(s) is/are cited in this Office Action (its/their serial number(s) will continue to be used in the subsequent course of examination):

Serial No.	Number or Title(s) of Document(s)	Date of Publication (or filing date of interfering application)
1	EP0705829A1	April 10, 1996
2	WO9709319A1	March 13, 1997
3		
4		

6. Concluding comments on the examination:

Li On the description:
☐ What is stated in the application comes within the scope of that no patent right shall be granted as prescribed in Art. 5 of the Patent Law.
☐ The description is not in conformity with the provision of Art. 26, para. 3 of the Patent Law.
☑ On the claims:
□ Claim(s) come(s) within the scope of that no patent right shall be granted
as prescribed in Art. 25 of the Patent Law.
\square Claims <u>1-4 and 7-11</u> have no novelty as prescribed in Art. 22, para. 2 of the
Patent Law.
\square Claims <u>1-14</u> have no inventiveness as prescribed in Art. 22, para. 3 of the Pater
Law.
☐ Claim(s) has/have no practical applicability as prescribed in Art. 22, para
4 of the Patent Law.
☑ Claims <u>1, 5, 13 and 14</u> are not in conformity with the provision of Art. 26, para. 4
of the Patent Law.
☑ Claims 1, 13, 14 and 15 are not in conformity with the provision of Art. 31, para.
of the Patent Law.
\square Claims <u>1,5 and 13</u> are not in conformity with the provisions of Rules 20 to 23 of
the Implementing Regulations.
□ Claim(s) is/are not in conformity with the provision of Art. 9 of the Patent
Law.
□ Claim(s) is/are not in conformity with the provision of Rule 12, para. 1 of the
Implementing Regulations

See the text portion of this Office Action for detailed analysis of the above concluding comments.

7.	ased on the above concluding comments, the examiner deems that the applicant should make amendment to the application document(s) according to the requirements put forward in the text portion of this Office Action. The applicant should expound in his/its observations why the captioned patent application is patentable and make amendment to what is not in conformity with the provisions pointed out in the text portion of this Office Action, otherwise, no patent right shall be granted. If the patent application contains no substantive content(s) for which a patent right patent application contains no sufficient reason(s) to state or his/its state reason(s) is/are not sufficient, said application will be rejected.	rith ght
8.	ne applicant should note the following items:	
	I) Under Art. 37 of the Patent Law, the applicant should submit his/its observation within four months from the date of receipt of this Office Action; if, without any justified reason(s), the time limit for making written response is not met, said application shall be deemed to have been withdrawn.	
	2) The amendment made by the applicant to said application should be in confount to the provision of Art. 33 of the Patent Law, the amended text should be in duplicate and its form should conform with the related provisions of the Guide Examination.	·
	3) If no arrangement is made in advance, the applicant and/or the agent shall r come to the Chinese Patent Office to have an interview with the examiner.	not
	4) The observations and/or amended text should be sent to the Receiving Section the Chinese Patent Office by mail or by personal delivery, if not sent to the Receiving Section by mail or by personal delivery, the document(s) will have no legal efforts.	eiving
9.	his Office Action consists of the text portion totalling <u>5</u> pages and of the follow attachment(s): 2 _2_ copies of the reference document(s) totalling page(s).	ving